

▼ユーゼル錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ホリナートカルシウム calcium folinate 【分類】還元型葉酸製剤

【単位】▼25mg/錠

【常用量】75mg/日

【用法】食間（食事前後1hrを避け、テガフル・ウラシル製剤と同時投与）28日間連日経口投与し、その後7日間休薬

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【保存期腎不全患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【特徴】ホリナートの光学活性体 (l 体) であるレボホリナートは Biochemical Modulation によりフルオロウラシルの抗腫瘍効果を増強させる。フルオロウラシルは活性代謝物であるフルオロデオキシウリジン酸 (FdUMP) が、チミジル酸合成酵素 (Thymidylate synthase : TS) と結合し、TS 活性を阻害することにより、チミジル酸合成を抑制し DNA 合成を阻害する。レボホリナートは細胞内で還元され、5, 10-CH₂-THF となる。この 5, 10-CH₂-THF は FdUMP、TS と強固な三元複合体 (Ternary complex) を形成し、TS の解離を遅延させることにより、フルオロウラシルの抗腫瘍効果を増強させる。従って、ホリナートとテガフル・ウラシルの併用により、テガフルの分解産物であるフルオロウラシルの抗腫瘍効果が増強される (1)

【副作用】UFT との併用療法：重篤な下痢、口内炎、血球減少、食欲不振、肝障害、白質脳症、嗅覚脱失、間質性肺炎、SJS、TEN など

【モニターすべき項目】CBC、肝機能等

【吸収】空腹時投与時と比べ、食後投与ではウラシル、FU の AUC は低下するため (1)、食事の影響を受けない空腹時投与が指示されている (1)

【F】5~30%：投与量増加により吸収率は低下する (1)

【tmax】1~3hr (1) 活性体：0.3~5hr (1)

【代謝】活性体は l 体で葉酸の代謝経路をたどる (1) FT から 5-FU への変換には CYP2A6 が関与 (1)

【排泄】尿中排泄率：l 体 30%、d 体 75% (1) 【CL/F】3.8L/h/m² (1)

【t1/2】未変化体：7hr、活性葉酸型：3.1hr (1)

【蛋白結合率】データなし (1)

【Vd/F】LV として 39.1L/m² (1)

【MW】511.50

【透析性】データなし (1)

【相互作用】TS-1 からの切り替え時には 7 日以上開ける (1)

【更新日】20130320

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。